(19) 世界知的所有権機関 国際事務局



(43) 国際公開日 2005年7月14日(14.07.2005)

(10) 国際公開番号 WO 2005/063293 A1

(51) 国際特許分類7:

A61K 45/00, 31/4453, 31/4545, 31/455, 31/5377, 31/4409, 31/4439, 31/55, C07D 295/12, 295/06, 213/81, 213/82, 213/83, 401/12, A61P 31/12, C12Q 1/48

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2004/019393

(22) 国際出願日:

2004年12月24日(24.12.2004)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ: 特願 2003-435085

2003年12月26日 (26.12.2003)

(71) 出願人 および

(72) 発明者: 萩原 正敏 (HAGIWARA, Masatoshi) [JP/JP]; 〒2620024 千葉県千葉市花見川区浪花町912-8 Chiba (JP).

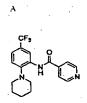
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 福原 武志 (FUKUHARA, Takeshi) [JP/JP]; 〒1130024 東京都 文京区西片 2-7-1-25 Tokyo (JP). 鈴木 正昭 (SUZUKI, Masaaki) [JP/JP]; 〒4610023 愛知県名古屋市東区徳川町1010-1202 Aichi (JP). 細 谷孝充 (HOSOYA, Takamitsu) [JP/JP]; 〒5020813 岐 阜県岐阜市福光東2丁目7番17号 サンライズ 88-605 Gifu (JP).

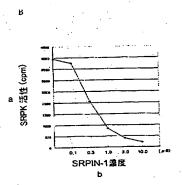
[続葉有]

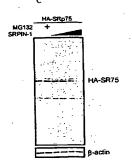
(54) Title: METHOD OF REGULATING PHOSPHORYLATION OF SR PROTEIN AND ANTIVIRAL AGENTS COMPRISING SR PROTEIN ACTIVITY REGULATOR AS THE ACTIVE INGREDIENT

(54) 発明の名称: SR蛋白質のリン酸化制御方法、および、SR蛋白質の活性制御剤を有効成分とする抗ウイルス剤



SRPIN-1(C18H18F3N3O) MW349.35





- SRPIN-1濃度(μM)
- a... SRPK ACTIVITY (cpm)
- b... SRPIN-1 CONCENTRATION
- c... HIVp24 ANTIGEN IN CULTURE SERUM (pg/ml)
- d... SRPIN-1 CONCENTRATION (µM)

(57) Abstract: It is intended to provide: (1) antiviral agents lowering or inhibiting the activity of an SR protein, more specifically speaking, (i) an antiviral agent promoting the dephosphorylation of an SR protein and (ii) an antiviral agent inhibiting a protein phosphorylating an SR protein; (2) an antiviral agent inhibiting the expression of an SR protein; and (3) an antiviral agent activating a protein having an opposite function to an SR protein. It is also intended to provide compounds which inhibit SRPK phosphorylating an SR protein. These compounds inhibit the activity of the SR protein and show an antiviral effect. Thus, antiviral agents which are efficacious against a novel virus and widely applicable and show a highly sustained effect are provided to cope with the occurrence of various novel viruses.

本願発明は、(1)SR蛋白 (57) 要約: 質の活性を低減又は阻害することによる抗 ウイルス剤、より具体的には、(i)SR蛋 白質の脱リン酸化を促進させることによる 抗ウイルス剤、及び(ii)SR蛋白質をリン 酸化させる蛋白質を阻害することによる抗 ウイルス剤、更に(2)SR蛋白質の発現 を阻害することによる抗ウイルス剤、並び (3) SR蛋白質と逆の機能をする蛋 白質を活性化することによる抗ウイルス剤 を提供する。また本発明は、SR蛋白質を リン酸化させるSRPKを阻害する化合物

WO 2005/063293 A1 を提供する。これらの化合物は、SR蛋白質の活性を阻害し抗ウイルス作用を示す。

- (74) 代理人: 清水 初志, 外(SHIMIZU, Hatsushi et al.); 〒 3000847 茨城県土浦市卸町 1-1-1 関鉄つくばビル 6 階 Ibaraki (JP).
- (81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護 が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA,

SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), $\neg - \neg \triangleright \gamma$ (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), $\exists - \neg \nu \wedge (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).$

添付公開書類:

- 一 国際調査報告書
- 電子形式により別個に公開された明細書の配列表部 分、請求に基づき国際事務局から入手可能

2文字コード及び他の略語については、 定期発行される 各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語 のガイダンスノート」を参照。